

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESES

Absender: INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

An:

Rec'd PCT/PTO 02 AUG 2005PCT

Eingegangen

siehe Formular PCT/ISA/220
26. JULI 2004

FRIST: 03.12.2004

UT 03.10.2004

**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN
RECHERCHENBEHÖRDE**
(Regel 43bis.1 PCT)

Absendedatum
(Tag/Monat/Jahr) siehe Formular PCT/ISA/210 (Blatt 2)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
siehe Formular PCT/ISA/220

WEITERES VORGEHEN
siehe Punkt 2 unten

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/000485

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)
22.01.2004

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
03.02.2003

Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK
C07D487/04

Anmelder
HF ARZNEIMITTELFORSCHUNG GMBH

1. Dieser Bescheid enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- Feld Nr. I Grundlage des Bescheids
- Feld Nr. II Priorität
- Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

2. WEITERES VORGEHEN

Wird ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung gestellt, so gilt dieser Bescheid als schriftlicher Bescheid der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde ("IPEA"); dies trifft nicht zu, wenn der Anmelder eine andere Behörde als diese als IPEA wählt und die gewählte IPEA dem Internationalen Büro nach Regel 66.1bis b) mitgeteilt hat, daß schriftliche Bescheide dieser Internationalen Recherchenbehörde nicht anerkannt werden.

Wenn dieser Bescheid wie oben vorgesehen als schriftlicher Bescheid der IPEA gilt, so wird der Anmelder aufgefordert, bei der IPEA vor Ablauf von 3 Monaten ab dem Tag, an dem das Formblatt PCT/ISA/220 abgesandt wurde oder vor Ablauf von 22 Monaten ab dem Prioritätsdatum, je nachdem, welche Frist später abläuft, eine schriftliche Stellungnahme und, wo dies angebracht ist, Änderungen einzureichen.

Weitere Optionen siehe Formblatt PCT/ISA/220.

3. Nähere Einzelheiten siehe die Anmerkungen zu Formblatt PCT/ISA/220.

Name und Postanschrift der mit der internationalen
Recherchenbehörde



Europäisches Patentamt
D-80298 München
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Baston, E

Tel. +49 89 2399-8229



Feld Nr. I Grundlage des Bescheids

1. Hinsichtlich der **Sprache** ist der Bescheid auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache erstellt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - Der Bescheid ist auf der Grundlage einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache erstellt worden, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (gemäß Regeln 12.3 und 23.1 b)).
2. Hinsichtlich der **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz**, die in der internationalen Anmeldung offenbart wurde und für die beanspruchte Erfindung erforderlich ist, ist der Bescheid auf folgender Grundlage erstellt worden:
 - a. Art des Materials
 - Sequenzprotokoll
 - Tabelle(n) zum Sequenzprotokoll
 - b. Form des Materials
 - in schriftlicher Form
 - in computerlesbarer Form
 - c. Zeitpunkt der Einreichung
 - in der eingereichten internationalen Anmeldung enthalten
 - zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht
 - bei der Behörde nachträglich für die Zwecke der Recherche eingereicht
3. Wurden mehr als eine Version oder Kopie eines Sequenzprotokolls und/oder einer dazugehörigen Tabelle eingereicht, so sind zusätzlich die erforderlichen Erklärungen, daß die Information in den nachgereichten oder zusätzlichen Kopien mit der Information in der Anmeldung in der eingereichten Fassung übereinstimmt bzw. nicht über sie hinausgeht, vorgelegt worden.
4. Zusätzliche Bemerkungen:

**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN RECHERCHEBEHÖRDE**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/000485

Feld Nr. II Priorität

1. Das folgende Dokument ist noch nicht eingereicht worden:
 - Abschrift der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist (Regel 43bis.1 und 66.7(a)).
 - Übersetzung der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist (Regel 43bis.1 und 66.7(b)).

Daher war es nicht möglich, die Gültigkeit des Prioritätsanspruchs zu prüfen. Der Bescheid wurde trotzdem in der Annahme erstellt, daß das beanspruchte Prioritätsdatum das maßgebliche Datum ist.
2. Dieser Bescheid ist ohne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da sich der Prioritätsanspruch als ungültig erwiesen hat (Regeln 43bis.1 und 64.1). Für die Zwecke dieses Bescheids gilt daher das vorstehend genannte internationale Anmelde datum als das maßgebliche Datum.
3. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erforderlichen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit	Ja: Ansprüche 1-22 Nein: Ansprüche
Erforderliche Tätigkeit	Ja: Ansprüche 1-22 Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ja: Ansprüche: 1-22 Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Sektion V

Die nachfolgenden dem Recherchebericht entnommenen Dokumente wurden der Beurteilung der vorgelegten Anmeldung zugrunde gelegt:

- D1: JEN, T. ET AL.: "Amidines. 5. Synthesis of Pyrrolo[2,3-b]isoquinoline, Imidazo[1,2-b]isoquinoline, Pyrrolo[2,1-b]quinazoline, and 1,3-Thiazino[2,3-b]quinazoline Derivatives and Related Heterocycles as Potential Antihypertensive Agents" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, Bd. 16, Nr. 6, 1973, Seiten 633-637,
- D2: YADAV, J.S.; REDDY, B.V.S.: "Microwave-assisted rapid synthesis of the cytotoxic alkaloid luotonin A" TETRAHEDRON LETTERS, Bd. 43, 2002, Seiten 1905-1907,
- D3: SPÄTH, E.; PLATZER, N.: "Über Derivate des Peganins und ihre Ring-Homologen" CHEMISCHE BERICHTE, 1935, Seiten 2221-2226,

Der vorliegende Antrag ist mit einem Verfahren zur Herstellung von 1,2,3,9-Tetrahydro-pyrrolo[2,1-b]chinazolin (Verbindung III) befasst. Diese wird durch Reduktion aus der Keto-Vorstufe (I) erhalten, welche ihrerseits aus Isatosäureanhydrid (II) unter Einwirkung von Pyrrolidon im Überschuss erhalten wird (Ansprüche 1-17,22). Des Weiteren bezieht sich die Anmeldung auf ein Verfahren welches Verbindung III als freie Base in geschmolzener Form aus dem salz freisetzt.

Die Dokumente D2 und D3 beschreiben Verfahren der Umsetzung von Pyrrolidon mit Verbindung II, jedoch immer unter erwendung von äquimolaren Mengen dieser beiden Komponenten. D1 beinhaltet ein Verfahren (schematische Darstellung III) der Bereitstellung von III unter Verwendung von ortho-aminobenzylamine und gamma-butyrolacton. Somit ist für die Ansprüche 1-22 Neuheit (Art. 33(2) PCT) zuzuerkennen.

Die Beschreibung enthält experimentelle Daten, welche aufzeigen, dass dem Einsatz eines molaren Überschusses an Pyrrolidon vorteilhafte Effekte insbesondere im Hinblick auf die zu erzielbare Ausbeute beizumessen sind (vgl. Beispiel 1, 21 % und Beispiel 2, 55 %). Obschon dies als eine logische Konsequenz der Gleichgewichtsverschiebung anzusehen ist, so muss die Tatsache, dass Verbindung I (Pegenon) ohne Pyrrolidon-Verunreinigung in kristallisierter Form erhalten werden kann doch als überraschend angesehen werden. Die Erfordernisse von Art. 33(3) PCT sind erfüllt.